

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property Organization

International Bureau



(43) International publication date

12 September 2003 (12.09.2003)

(10) International publication number

WO 03/074088 A2

PCT

(51) International patent classification<sup>7</sup>: A61K 47/48

(21) International application number: PCT/EP03/02084

(22) International filing date: 28 February 2003 (28.02.2003)

(25) Language of filing: German

(26) Language of publication: German

(30) Data relating to the priority:  
102 09 822.0 6 March 2002 (06.03.2002) DE

(71) Applicant (for all designated States except US):  
BIOTECHNOLOGIE – GESELLSCHAFT MITTELHESSEN  
MBH [DE/DE]; Kerkrader Strasse 7, 35394 Giessen (DE).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (US only): ORLANDO, Michele  
[IT/DE]; Eichendorffring 107, 35394 Giessen (DE).  
HEMBERGER, Jürgen [DE/DE]; Kiebitzweg 2, 35741  
Aschaffenburg (DE).

(74) Representatives: GRÜNECKER, KINKELDEY, STOCK-  
MAIR & SCHWANHÄUSSER; Anwaltssozietät,  
Maximilianstrasse 58, 80538 Munich (DE).

(81) Designated states (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU,  
AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR,  
CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE,  
GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR,  
KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK,  
MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU,  
SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA,  
UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Designated states (regional): ARIPO Patent (GH, GM,  
KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),  
Eurasian Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,  
TM), European Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE,  
DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL,  
PT, SE, SI, SK, TR), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI,  
CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Published:

- Without the International Search Report and to be  
republished once the report has been received.

For an explanation of the two-letter codes and the other  
abbreviations, reference is made to the explanations  
("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") at the  
beginning of each regular edition of the PCT Gazette

As printed

(54) Title: COUPLING LOW-MOLECULAR SUBSTANCES TO A MODIFIED POLYSACCHARIDE

(54) Bezeichnung: KOPPLUNG NIEDERMOLEKULARER SUBSTANZEN AN EIN MODIFIZIERTES POLYSACCHARID

(57) Abstract: The invention relates to a method for coupling low-molecular substances to a starch-derived modified polysaccharide. The binding interaction between the modified polysaccharide and the low-molecular substance is based on a covalent bond which is the result of a coupling reaction between the terminal aldehyde group or a functional group of the modified polysaccharide molecule resulting from the chemical reaction of this aldehyde group and a functional group of the low-molecular substance which reacts with this aldehyde group or with the resulting functional group of the polysaccharide molecule. The bond directly resulting from the coupling reaction can be optionally modified by a further reaction to the aforementioned covalent bond. The invention further relates to pharmaceutical compositions that comprise conjugates formed in this coupling process and to the use of said conjugates and compositions for the prophylaxis or therapy of the human or animal body.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft die Kopplung von niedermolekularen Substanzen an ein von Stärke abgeleitetes modifiziertes Polysaccharid, wobei die bindende Wechselwirkung zwischen dem modifizierten Polysaccharid und der niedermolekularen Substanz auf einer kovalenten Bindung beruht, welche das Ergebnis einer Kopplungsreaktion zwischen der endständigen Aldehydgruppe oder einer aus dieser Aldehydgruppe durch chemische Umsetzung hervorgegangenen funktionellen Gruppe des modifizierten Polysaccharidmoleküls und einer mit dieser Aldehydgruppe oder daraus hervorgegangenen funktionellen Gruppe des Polysaccharidmoleküls reaktionsfähigen funktionellen Gruppe der niedermolekularen Substanz ist, wobei die bei der Kopplungsreaktion unmittelbar resultierende Bindung gegebenenfalls durch eine weitere Reaktion zur obengenannten kovalenten Bindung modifiziert sein kann. Die Erfindung betrifft ferner pharmazeutische Zusammensetzungen, welche die bei der Kopplung gebildeten Konjugate umfassen, und die Verwendung dieser Konjugate und Zusammensetzungen zur prophylaktischen oder therapeutischen Behandlung des menschlichen oder tierischen Körpers.

WO 03/074088 A2